

**Cited Document 4**

Claim 1. A composition comprising:

(1) any one or more pure sugars selected from the group consisting of meso-erythritol, xylitol, D(+)-galactose, D(+)-lactose, D(+)-xylose, dulcite, myo-inositol, L(-)-fructose, D(-)-mannitol, sorbitol, D(+)-glucose, D(+)-arabinose, D(-)-arabinose, cellobiose, D(+)-maltose, D(+)-raffinose, L(+)-rhamnose, D(+)-melibiose, D(-)-ribose, adonite, D(+)-arabitol, L(-)-arabitol, D(+)-fucose, L(-)-fucose, D(-)-lyxose, L(+)-lyxose, L(-)-lyxose, D(+)-glucosamine, D-mannosamine, and D-galactosamine; and

(2) any one or more amino acids selected from the group consisting of glutamine, lysine, arginine, asparagine, aspartic acid, cysteine, glutamic acid, glycine, histidine, leucine, methionine, phenylalanine, proline, serine, threonine, tryptophan, tyrosine, valine, and taurine.

To overcome drunkenness

The composition described above is desirable to overcome drunkenness. A minimum effective dose of the substance for a rapid action depends on the body weight of a subject. For a 100-pound (45 kg) individual, a minimum dose of high-purity sugar is about 1.2 grams, and a minimum dose of amino acids is about 400 milligrams. For a 200-pound (91 kg) individual, a minimum dose of high-purity sugar is about 2.0 to 2.5 grams, and a minimum dose of amino acids is about 480 milligrams. One is for recovery of motor function, and the other is for alcohol metabolism. A high-purity sugar is needed to recover motor function quickly. An adequately rapid metabolism of alcohol merely requires sugar with 90% or more purity. When a minimum dose of "pure" sugar is added, a mixture of sugars may be used. A combination of high-purity sugar and amino acids, when taken in a liquid form or as a solution, enables recovery of motor function within one minute or less, usually within 30 seconds, after orally taken. The blood alcohol level of a normal 200-pound individual who has had 6 ounces (17 grams) of 80 proof alcohol and orally taken the substance of the invention in a liquid form is reduced to less than 0.05% within 30 minutes. This relatively quick detoxification is in part by the amino acids.

⑨ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

## ⑪ 公開特許公報 (A) 平3-52810

⑫ Int. Cl. 5

A 61 K 31/195  
31/405  
31/415  
31/70  
47/26

識別記号

AGA  
ADQ  
ACZ  
Z

序内整理番号

7252-4C  
7475-4C  
7475-4C  
7431-4C  
7624-4C

⑬ 公開 平成3年(1991)3月7日

審査請求 未請求 請求項の数 8 (全5頁)

⑭ 発明の名称 血液細胞門を通過する物質

⑮ 特願 平1-186086

⑯ 出願 平1(1989)7月20日

⑰ 発明者 アルバート・泰イー・メサ、シボラ・アベニュー  
ナイター 2776⑯ 出願人 アルバート・泰イー・メサ、シボラ・アベニュー  
ナイター 2776

⑰ 代理人 弁理士 倉内 基弘 外1名

## 明細書

## 1. 発明の名称

血液細胞門を通過する物質

## 2. 特許請求の範囲

1. (1) 下記からなる群より選ぶいずれか1つ或はそれ以上の純種: メソエリトリトール、キシリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイノシトール、L (-) フルクトース、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (-) アラビノース、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニット、D (+) アラビトール、L (-) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース、D (+) グルコサミン、D マンノサミン及びD ガラクトサミン: 及び  
(2) 下記からなる群より選ぶいずれか1つ或はそれ以上のアミノ酸: グルタミン、リシン、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グリシン、ヒスチジン、ロイシン、メオニン、フェニルアラニン、プロリシン、セリン、トレオニン、トリプトファン、チロシン、バリン及びカウリンを含む組成物。  
2. 更に、ベータカロチン或はキサントフィルの内少なくとも1種を有する分量含む特許請求の範囲第1項記載の組成物。  
3. 量1250mg当たり、アミノ酸400mg或はそれ以上、ベータカロチン及びキサントフィルのいずれか一方或はこれらの組合せ3mgを含む特許請求の範囲第1項記載の組成物。  
4. (1) 下記からなる群より選ぶいずれか1つ或はそれ以上の純種: メソエリトリトール、キシリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイ

ノシトール、L (-) フルクトース、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (+) アラビノース、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニット、D (+) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース、L (-) リキソース、D (+) グルコサミン、D マノサミン及びD ガラクトサミン；及び

(2) ある分量のベータカロチン成はキサントフィルの内の少なくとも1種を含む組成物。

5. (1) 下記からなる群より選ぶいすれか1つ成はそれ以上の純度：キシリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイノシトール、L (-) フルクトース、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (+) アラビノース

ス、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニット、D (+) アラビトール、L (-) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース及びL (-) リキソース；及び

(2) 下記からなる群より選ぶいすれか1つ成はそれ以上のアミノ酸：アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システィン、グルタミン酸、グリシン、ヒスチジン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、プロリン、セリン、トレオニン、グルタミン、リシン、トリプトファン、チロシン、バリン及びタウリン

を、群の各々の量1.25～5グラム当りのアミノ酸の累積量を400ミリグラム以上にするような量で含む組成物。

6. 組及びアミノ酸を、下記の群：キシリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイノ

シトール、L (-) フルクトース、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (+) アラビノース、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニット、D (+) アラビトール、L (-) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース及びL (-) リキソースからの量1.25～5グラム及びアルギニン、トリプトファン及びチロシンの内の1種成はそれ以上の少なくとも400ミリグラムの割合で含む組成物。

7. 更に、可食性防腐剤及び着色剤をある量で含む特許請求の範囲第1項記載の組成物。

8. アミノ酸の少なくとも一部が天然産の食品に含有される特許請求の範囲第1項記載の組成物。

### 3. 発明の詳細な説明

#### 産業上の利用分野

本発明は前の物質を血液脳関門の中に通す及び輸送する物質及び方法に関する。本発明は、特にアルコール中毒の作用を克服する及び発頭痛を克服する物質及び方法に関する。

#### 背景の技術

ほとんどの生理的機能が脳によって制御されており、その制御の媒体は脳内の化学的活性へのインシデントとしての電気的信号法であるという前提を認めるならば、その活性に必要とされる化学物質が脳内に無くなれば信号不全、及びその結果、生理的無機能に至り得ると結論することは論理にかなっていると思われる。また、所定の物質が脳内に存在すれば制御信号の適当な発生を化学的に妨げ得ると結論することが可能である。

このような考察、薬剤從属症、肺臓、発頭痛及びその他の疾病、脳に関連するいくつかの病気、等の機構を理解する調査は多くの研究者が脳内のこのような疾病と化学物質の利用性との間の関係をさがすのを明らかに拒否してきた。医学文献に、所定の病気で死んだ人の脳組織を関係のない

原因で死んだ人の脳組織と比べて所定の化学物質と気体との間に関係があることを提案する記述が載っている。これによれば、リチウムの欠乏が精神分裂病に関係すると述べられ、神経ペプチドの欠乏がアルツハイメリ病に関係すると述べられた。

その紙における研究、脳癌の化学的治療及びその他の研究及び手順は、一般に血液脳関門とよばれているもののために化学物質を脳に導入する際の困難性によって妨げられる。脳の血管は体のどこか他の血管に比べて一層最密な組織で形成されている。そのこと及び星状細胞の作用は、多くの物質が脳の神経細胞に導入し難いことの原因となる。いくつかの場合では、研究者がそれらの物質を脳に導入する唯一の方法は被検者の頭骨に孔を形成して所望の物質を脳の中に注入することであつた。

発明の目的は血液脳関門を通して物質を輸送するビクル及び方法を提供するにある。

別々の目的は特定の疾患の研究及びいくつかの場

合には治療に適した特定の物質を提供することにある。それらの疾患の内の一つは毛髪の損失であり、別々のものは膝蓋へのインシデントとしての運動機能の損失である。

#### 星状細胞

本明細書中以降で明らかになるものと思う発明のこれらや他の目的及び利点は、通常血液脳関門を通過することができない物質の血液から脳への迅速な通過を促進する物質及びこのような物質と、例えば妨げられる神経伝導物質（ニューロトランシミッター）の機能を回復し及び毛髪生長の回復を促進することができる他の物質との結合せを提供することによって達成される。他の物質を関門の中に通して輸送することに関して責任のある物質は多數の微粉状の極めて純粋な物質或はアミノ酸の内の中のいずれか一つの単独或はこれらの組合せである。組は下記である：メソエリトリトル、キシリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイノシトール、L (-) フルクトー

ス、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (+) アラビノース、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニット、D (+) アラビトール、L (-) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース、L (-) リキソース、D (+) グルコサミン、D マンノサミン及びD ガラクトサミン。本明細書中、特に適用する通りの「純」なる用語は結晶純度97～99%の純度を意味する。高純度を要件とすることは、純度を必要とするごと及び不純物の性質がわかつておらず、いくつかの不純物は構成はアミノ酸の有効性を無効にすることの両方にに基づく。微粉化を要件とすることは、主に迅速な作用を望むことにに基づく。

筋筋被検者の運動機能を迅速に回復することを目的とする場合、闇を下記のリストから選用するある分量の1種或はそれ以上のアミノ酸と組合わ

せる。アミノ酸は下記である：グルタミン、リシン、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システィン、グルタミン酸、グリシン、ヒスチジン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、プロリン、セリン、トレオニン、トリプトファン、チロシン、バリン及びタウリリン。アミノ酸は普通の食品、例えばオレンジジュース、クラムチャウダー、大豆スープ、牛乳、等の中に見出されるものにことができるが、結果を均一にしかつて簡便に可能にするために、アミノ酸を結晶の形で加入するのが好ましい。

体の中のエーテルが過剰になる結果として運動機能の調節を失った者に運動機能を迅速に回復させるのが目的の場合、アミノ酸が必須成分である。他の物質を血液脳関門を通して脳に導入することを目的とする場合、アミノ酸は望ましいが、明らかに必須成分ではない。これより、例えばある分量の1種或はそれ以上の上述した組をペーパーカロチソウはキサンチフィルと共に摂取すれば毛髪の生長を促進するが、その生長プロセスは、上

記からのアミノ酸を加える場合に促進される。

添加する試験或は治療用物質のそれらの相性を組合せする割合及びその組合せの量は共に試験用被検者の性質及び重量によって変わる。ヒトの場合、上記した他のいずれかの過度の量ははき氣、発熱感覚、潤紅及び耳鳴りを引き起こし得る。一度に投与する量を5グラムより多くすれば上述した悪い副作用を生じ得る。アミノ酸の量を過剰にすれば所定の病氣にかかった被検者に対し有害な作用を与える他は、安全に摂取するアミノ酸の量に上限はない。

#### 絶えない実施標準の説明

アミノ酸の組合はアルコールの作用を克服し及び運動機能の迅速な回復を達成する能は必須でないが、他の物質を筋に輸送するのに有用であり、それで、好みしい実施標準では加入する。これより、発明の好みしい物質は血液脳関門を通りかつ他の物質を脳門を通して輸送する能力を有するものであり、多数の純度とは純アミノ酸の内の1種成はそれ以上と多数のアミノ酸の内の1種成はそ

れ以上との組合せを含む。組は下記の通りである：メソエリトリトール、チリトール、D (+) ガラクトース、D (+) ラクトース、D (+) キシロース、ズルシット、ミオイノシトール、L (-) フルクトース、D (-) マンニトール、ソルビトール、D (+) グルコース、D (+) アラビノース、D (-) アラビノース、セロビオース、D (+) マルトース、D (+) ラフィノース、L (+) ラムノース、D (+) メリビオース、D (-) リボース、アドニトール、D (+) アラビトール、L (-) アラビトール、D (+) フコース、L (-) フコース、D (-) リキソース、L (+) リキソース及びL (-) リキソース。本明細書中、組に適用する通りの「純」なる用語は結晶純度97～100%純度の微粉状を意味する。アミノ酸はD (+) グルコサミン、D マンノサミン及びD ガラクトサミンである。本明細書中以降で、アミノ酸は「組」なる用語に含まれる。

アミノ酸は下記である：グルタミン、リシン、

アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システィン、グルタミン酸、グリシン、ヒスチジン、ロイシン、メチオニン、フェニルアラニン、プロリシン、セリン、トレオニン、トリプトファン、チロシン、バリン及びタウリン。アルギニン、トリプトファン、チロシンが現時点で好みしい。発明の物質を、例えば、水或はオレンジジュース等の液体で経口摂取するのがずっと好みしい。

#### 點滴作用の実験

點滴作用の克服を目的とする場合に、上述した組成物が好みしい。迅速に作用するための物質の最少有効量は被検者の体重に依存する。100ボンド(45kg)の個体の場合、高純度組の最少量は約1.2グラムであり、アミノ酸の最少量は約400ミリグラムである。200ボンド(91kg)の個体の場合、最少量は高純度組約2.0～2.5グラムであり、アミノ酸約480ミリグラムである。一方は運動機能を回復するためであり、他方はアルコールを代替するためである。運動機能

経を迅速に回復するには高純度組を要する。アルコールの過度に迅速な代謝を促進するためには、組の純度を90%又はそれ以上にすることを要するだけである。最少量の「純」組を入れる場合、組の混合物も許される。高純度組とアミノ酸との組合せは、液状で或は液体で摂取する場合、経口摂取した後、1分より短い時間で、通常30秒以内で運動機能を回復するに至る。80ブルーフアルコールを6オンス(17グラム)摂取しておきかつ発明の物質を液体の形で経口摂取する通常の200ボンドの個体における血中アルコールの量を30分以内で0.05%より低く低減せしめる。比較的迅速な効率は一部アミノ酸を含むことによる。

#### 毛髪生長

所定の物質は毛髪の損失を遮らせるのに有用であることが立証された。毛髪の損失を減少させかつ毛髪を回復させる両方である程度良好な結果が得られると称する有機製品は多數市販されている。それらは外部適用し、毛髪細胞の表面でニ

ユーロリセプターとして働くものと考えられている。発明の物質はペータカロチン及び／又はキサントフィルであり、これは神経膜に導入した際毛包に信号を見して作用させる神経伝導物質として働くことができる。試験は、ペータカロチン及び／又はキサントフィルを上述した1種吸はそれ以上の高純度液と共に摂取の場合に、毛髪生長を促進することを立証する。頭の領域における毛髪生長は前にはげていた。1つの試験では、ペータカロチン3.0mgをオレンジジュース250ml中のフルクトース25.000mgと共に毎日45日間摂取したところ、使用者の毛の生え際における毛髪損失を停止しかつ頭の領域において新しい毛髪が生長するに至った。自然の毛髪色が黒色であり、グレーに変った被検者は、45日の試験の終りに事实上黒色だけの頭蓋毛及び体毛を有していた。

試験は、ベース物質、即、アミノ酸が上述した量で、ペータカロチン及びその他の物質を約半時間で摂取するに至るのに有効であることを示す。

それが、被がその頭部血液中に残るためであるか或はその期間維持する脳内の作用を生じるためにあるかどうかはわからっていない。しかし、ペータカロチンは、その作用のために、ベース物質と共に摂取する必要はなく、結局取り出される点において摂取することができる。ペータカロチンの臨界投与量はないように思われる。ペータカロチンは摂取することから、かつその推奨される摂取の量は5000IUであることから、現時点で、その量が好ましい量少であると考えられる。ペータカロチンの量を50,000IUよりも多くしても毛髪回復の促進は検察されなかった。そのため、現時点で、50,000IUがそれ以上増大させても費用を増大するだけで利点をそれ以上生じない上限であると考えられる。ペータカロチン及びキサントフィルは同等に有効である。